

2/5/9

DIALOG(R)File 352:Derwent WPI  
000518229

WPI Acc No: 1966-18776F/196800

Aminoethylsulphonic acid

Patent Assignee: TAISHO SEIYAKU CO LTD (TAIS )

Number of Countries: 001 Number of Patents: 001

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week
JP 65023007	B					196800 B

Priority Applications (No Type Date): JP 6322186 A 19630430

Abstract (Basic): JP 65023007 B

Process for the prepn. of beta-aminoethylsulphonic acid (taurine)

(I) which comprises passing a rapid stream of SO<sub>2</sub> into a 2-8% aq. soln. of ethyleneimine (II) at < 18 deg. pH is adjusted to 5-6, mixture is allowed to warm spontaneously to 35-45 deg., and pH is readjusted to 6 (with SO<sub>2</sub>), and soln. is concd. to afford (I).

Simple, economic, single-stage process affords pure (I) in high yield without formation of by-products and polymers. (I) (in combination with bile acids as taurocholic acid) promotes detoxification function of liver, and (I) also has anti-pyretic and sedative activity.

## アミノエチルスルホン酸の製造法

特 願 昭 38-22186  
出 願 日 昭 38.4.30  
発 明 者 寺島文一郎  
東京都豊島区高田南町3の724  
同 山崎由規  
同所  
同 山岸康一  
同所  
同 二宮美貴雄  
同所  
出 願 人 大正製薬株式会社  
東京都豊島区高田南町3の724  
代 表 者 上原昭二  
代 理 人 弁理士 塩崎正広

## 発明の詳細な説明

本発明はアミノエチルスルホン酸の製造法に関するものである。詳しくはエチレンジイミンに亜硫酸ガスを作用せしめてアミノエチルスルホン酸を容易に製造することを目的とし、且工業的製造化に合致した有益な方法を提供することにある。

本発明による方法の特徴とするところはエチレンジイミン水溶液に亜硫酸ガスを作用させて、先ずエチレンジイミンの酸性亜硫酸塩を液中に生成せしめ、これを開裂してアミノエチルスルホン酸を生成せしめるものであつて、亜硫酸ガスの導入は水素イオン濃度が5~6の範囲になるようにまた液温の上限を18℃にし、可及的速に行ない、亜硫酸ガスを吸収せしめた後、液温を35~45℃に上げて保持しつつ、反応せしめるにあつて、本発明の方法によれば後記に述べる如く、イミンが重合することなく、また無機塩、その他の副生物を生起することなく目的物を容易に取得できるものである。

通常アミノエチルスルホン酸はタウリンと称せられ、胆汁酸と結合してタウロコール酸として存在するものであり、その生理学的意義は極めて重要である。例えば肝臓の解毒機能を亢進し、組織細胞を賦活する作用がある。従つて解毒、疲労回復、滋養強壮、解熱、鎮静等の薬理作用を有する有用な化合物である。

従来知られているアミノエチルスルホン酸の製造法には2-臭化エチルスルホン酸にアンモニアを作用させるか2-臭化エチルアミンに無水亜硫酸ソーダを作用せしめる方法がある。しかしながら該方法はいずれも反応過程中多量の無機塩を生起する。ためにそれを分離析出するには多量の濃塩酸を要し、これを濃縮し、或は更にアミノエチルスルホン酸を沈降せしめるときに多量のアルコールを用い

るなど、純粋なアミノエチルスルホン酸を分取するまでに非常に煩雑な操作と多量の溶媒を要するものである。

ケミシエ・ベリヒテ第21巻、2667~2668、1888年によればエチレンジイミン水溶液に亜硫酸を作用せしめてアミノエチルスルホン酸を得ており、理論上では目的物を生成するが、実際には強塩基性のエチレンジイミン水溶液に通常の方法で亜硫酸を接触せしめたのではイミンの重合を生起して目的物を殆んど取得できず、工業的製造法としては全く顧みられず利用するには適切なものでない。

しかるに本発明者らは前記の目的を達成せんがため、この反応機構と条件を追求した結果、反応如何によつてはアミノエチルスルホン酸を実用上容易に製造し得るものとし、更に反応至適条件を種々検討して工業的に極めて有利な方法として開発することに成功した。

即ち本発明の方法はエチレンジイミンを2~8%水溶液とし、これを冷却、18℃以下に保持しつつ急速に望ましくは1分間に2kg程度の速度で、亜硫酸ガスを導入して吸収せしめる。この際に水素イオン濃度を5~6に調整するを要する。

もし導入時緩除に失すると1次反応の完結を待たず、2次反応が誘発し、液温の抑制が困難となり、イミンの重合を生起して目的物を工業的に得ることができない。

水素イオン濃度が5~6の範囲になるように亜硫酸ガスを導入した後冷却を中止する。冷却を止めれば液温は35~45℃に達するがそのまま暫時放置する。

このとき液の水素イオン濃度はアルカリ側に戻るから、更に亜硫酸ガスを導入して液のpHを再び6に補正することが必要である。反応終了後、反応液を濃縮すれば粗製のアミノエチルスルホン酸が結晶として析出する。本発明の方法によれば従来の方法と異なり、無機塩を全く含まないので、水より1回再結晶することにより純品となる。

本発明による反応条件で亜硫酸ガスをエチレンジイミン水溶液に導入した場合、亜硫酸は完全に液中に吸収されて、外部に放散せず、操作極めて容易にして、しかも無機塩を副生することもなく純品が簡単に取得できる。

以下その実施例を記載する。

## 実施例

5.35%のエチレンジイミン水溶液920lを冷却しつつ、亜硫酸ガスを約30分間に導入し、pH5.0に至らしめる。導入開始時の液温は0℃とし、導入中の液温上限は18℃とする。(亜硫酸ガス導入時間を30分とすれば液の冷却は液中に氷塊を浮べるのみにて足る。)亜硫酸の導入及び液の冷却を止めれば、液温は速かに上昇して40~45℃に達する。この際水素イオン濃度が若干アルカリ側に戻るから更に亜硫酸でpH6に修正する。

反応液は濃縮し、析出する粗製アミノエチルスルホン酸をろ取し、純水より精製すれば純品を得。

取得量 125kg、分解点 315℃、収率 87.8%

特許請求の範囲

1 エチレンイミンの 2～8%水溶液を冷却し、これに液温 18℃を上限として亜硫酸ガスを急速に導入し、pH 5～

6 となしたる後、液温 35～45℃ の上昇を起さしめ、亜硫酸にて pH 6 に補正し、次いで濃縮、精製することを特徴とするアミノエチルスルホン酸の製造法。